

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成23年12月22日 (2011.12.22)

【公表番号】特表2008-523134(P2008-523134A)

【公表日】平成20年7月3日 (2008.7.3)

【年通号数】公開・登録公報2008-026

【出願番号】特願2007-546165(P2007-546165)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/04 1 4 3

C 0 7 D 487/04 C S P

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/553

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【誤訳訂正書】

【提出日】平成23年11月1日 (2011.11.1)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

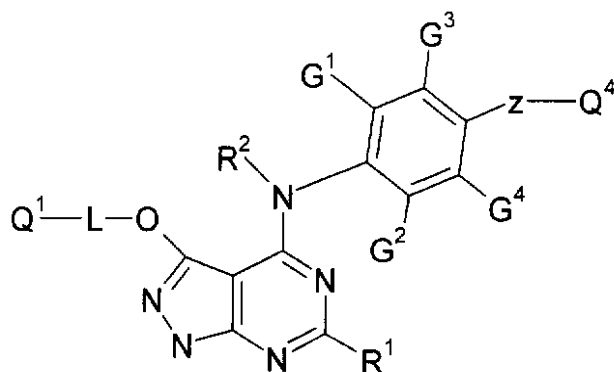
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩：

【化 1】



式 I

[式中、R¹は、水素、トリフルオロメチル、(1-3C)アルキル及び(1-3C)アルコキシから選

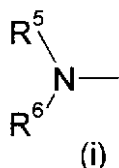
択され；

R^2 は、水素及び(1-6C)アルキルから選択され；

L は $-(CR^3R^4)_y-$ であり、ここで y は、1、2、3または4であり、 R^3 及び R^4 はそれぞれ独立して、水素及び(1-6C)アルキルから選択され；

Q^1 は、ヒドロキシ、イソインドリル、(1-6C)アルキル、(3-8C)シクロアルキル及び(3-8C)シクロアルケニルから選択されるか、または Q^1 は、式(i)：

【化2】



の基であり、ここで R^5 及び R^6 は、独立して水素、(1-6C)アルキル、(2-6C)アルカノイル及び(1-6C)アルコキシカルボニルから選択されるか、または R^5 及び R^6 はこれらが結合している窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素及び硫黄から独立して選択される一つ以上の追加のヘテロ原子を場合により含む4、5、6または7員のヘテロサイクリル基を形成する、

ここで、 Q^1 -L-基内の任意の(2-6)アルキレン鎖内の隣接する炭素原子は、場合により、O、S、SO、SO₂、N(R^7)、CO、CH(OR⁷)、CON(R^7)、N(R^7)CO、SO₂N(R^7)、N(R^7)SO₂、CH=CH及びC—C(ここで、 R^7 は水素または(1-6C)アルキルである)から選択される基を鎖の中に挿入することによって隔てられており、

及び(3-8C)シクロアルキル、(3-8C)シクロアルケニルまたはヘテロサイクリル基以外の Q^1 -L-基内の任意のCH₂またはCH₃基は、場合により、それぞれのCH₂またはCH₃基の上に、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルスルホニルオキシ、(1-6C)アルキルスルフィニルオキシ、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルカルバモイル、 \underline{N} 、 \underline{N} -ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキルスルファモイル、 \underline{N} 、 \underline{N} -ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及び \underline{N} -(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノから、あるいは式：

$-X^1-Q^2$

{式中、 X^1 は直接結合であるか、またはO、S、SO、SO₂、N(R^8)、CO、CH(OR⁸)、CON(R^8)、N(R^8)CO、SO₂N(R^8)、N(R^8)SO₂、C(R^8)₂O、C(R^8)₂S及びN(R^8)C(R^8)₂から選択され、ここで R^8 はそれぞれ独立して水素または(1-6C)アルキルであり、及び Q^2 は、アリール、アリール-(1-6C)アルキル、(3-8C)シクロアルキル、(3-8C)シクロアルキル-(1-6C)アルキル、(3-8C)シクロアルケニル、(3-8C)シクロアルケニル-(1-6C)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(1-6C)アルキル、ヘテロサイクリル若しくはヘテロサイクリル-(1-6C)アルキルから選択され、

ここで Q^1 -L-基内の任意の(3-8C)シクロアルキル、(3-8C)シクロアルケニル、ヘテロサイクリル、アリールまたはヘテロアリール基は、場合により、同一または異なっているもよい、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、ホルミル、(1-6C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ、(2-6C)アルキニルオキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルカルバモイル、 \underline{N} 、 \underline{N} -ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、アミノ(2-6C)アルカノイル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルアミノ(2-6C)アルカノイル、 \underline{N} 、 \underline{N} -ジ-[(1-

-6C) アルキル] アミノ (2-6C) アルカノイル、 $\underline{\text{N}}$ -(1-6C) アルキルスルファモイル、 $\underline{\text{N}}, \underline{\text{N}}$ -ジ-[(1-6C) アルキル] スルファモイル、(1-6C) アルカンスルホニルアミノ及び $\underline{\text{N}}$ -(1-6C) アルキル-(1-6C) アルカンスルホニルアミノから選択される一つ以上の置換基を保持する}の基から、あるいは式：

$-\text{X}^2-\text{R}^9$

{ 式中、 X^2 は直接結合であるか、または0及び $\text{N}(\text{R}^{10})$ から選択され、ここで R^{10} は水素または(1-6C) アルキルであり、及び R^9 は、ハロゲノ-(1-6C) アルキル、ヒドロキシ-(1-6C) アルキル、(1-6C) アルコキシ-(1-6C) アルキル、シアノ-(1-6C) アルキル、カルボキシ-(1-6C) アルキル、アミノ-(1-6C) アルキル、 $\underline{\text{N}}$ -(1-6C) アルキルアミノ-(1-6C) アルキル、 $\underline{\text{N}}, \underline{\text{N}}$ -ジ-[(1-6C) アルキル] アミノ-(1-6C) アルキル、カルバモイル-(1-6C) アルキル、 $\underline{\text{N}}$ -(1-6C) アルキルカルバモイル-(1-6C) アルキル、 $\underline{\text{N}}, \underline{\text{N}}$ -ジ-[(1-6C) アルキル] カルバモイル-(1-6C) アルキル、(2-6C) アルカノイル-(1-6C) アルキルまたは(1-6C) アルコキシカルボニル-(1-6C) アルキルから選択される}の基から、あるいは式：

$-\text{X}^3-\text{Q}^3$

{ 式中、 X^3 は直接結合であるか、または0、CO及び $\text{N}(\text{R}^{11})$ から選択され、ここで R^{11} は水素または(1-6C) アルキルであり、及び Q^3 は、アリール、アリール-(1-6C) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(1-6C) アルキル、(3-8C) シクロアルキル、(3-8C) シクロアルキル-(1-6C) アルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリル-(1-6C) アルキルから選択され、この Q^3 基は、場合によりハロゲノ、(1-6C) アルキル及び(1-6C) アルコキシから選択される、同一または異なっているもよい、一つ以上の置換基を保持する}の基から選択される、同一または異なっているもよい、一つ以上の置換基を保持し、

ここで Q^1 -L-基内の任意のヘテロサイクリルまたはイソインドリル基は、1または2個のオキソまたはチオキソ置換基を保持する；

G^1 及び G^2 はそれぞれ独立して、水素及びハロゲノから選択され；

G^3 及び G^4 はそれぞれ独立して、水素、ハロゲノ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、(1-6C) アルキル、(2-8C) アルケニル、(2-8C) アルキニル、(1-6C) アルコキシ、(2-6C) アルケニルオキシ、(2-6C) アルキニルオキシ、(1-6C) アルキルアミノ、ジ-[(1-6C) アルキル] アミノ、アリール及びヘテロアリールから選択され、

G^3 及び G^4 のどちらかの中の任意のアリールまたはヘテロアリール基は、場合により、ハロゲノ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、(1-6C) アルキル、(2-8C) アルケニル、(2-8C) アルキニル、(1-6C) アルコキシ、(2-6C) アルケニルオキシ、(2-6C) アルキニルオキシ、(1-6C) アルキルチオ、(1-6C) アルキルスルフィニル、(1-6C) アルキルスルホニル、(1-6C) アルキルアミノ及びジ-[(1-6C) アルキル] アミノから選択される、同一または異なっているもよい、一つ以上の置換基を保持する；

Zは直接結合であるか、または0、S、SO、 SO_2 、 $\text{N}(\text{R}^{12})$ 、 $\text{CH}(\text{OR}^{12})$ 、CO、 $\text{CON}(\text{R}^{12})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{12})\text{CO}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{12})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{12})\text{SO}_2$ 、 $\text{C}(\text{R}^{12})_2$ 、 $\text{OC}(\text{R}^{12})_2$ 、 $\text{C}(\text{R}^{12})_2\text{O}$ 、 $\text{SC}(\text{R}^{12})_2$ 、 $\text{C}(\text{R}^{12})_2\text{S}$ 、CO、 $\text{C}(\text{R}^{12})_2\text{N}(\text{R}^{12})$ 及び $\text{N}(\text{R}^{12})\text{C}(\text{R}^{12})_2$ から選択され、ここで R^{12} はそれぞれ独立して、水素または(1-6C) アルキルである、

Q^4 は、アリールまたはヘテロアリールであり、このアリールまたはヘテロアリールは、場合により、ハロゲノ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、ホルミル、カルバモイル、スルファモイル、メルカプト、(1-6C) アルキル、(2-8C) アルケニル、(2-8C) アルキニル、(1-6C) アルコキシ、(2-6C) アルケニルオキシ、(2-6C) アルキニルオキシ、(1-6C) アルキルチオ、(1-6C) アルキルスルフィニル、(1-6C) アルキルスルホニル、(1-6C) アルキルアミノ、ジ-[(1-6C) アルキル] アミノ、(1-6C) アルコキシカルボニル、 $\underline{\text{N}}$ -(1-6C) アルキルカルバモイル、 $\underline{\text{N}}, \underline{\text{N}}$ -ジ-[(1-6C) アルキル] カルバモイル、(2-6C) アルカノイル、(2-6C) アルカノイルオキシ、(2-6C) アルカノイルアミノ、 $\underline{\text{N}}$ -(1-6C) アルキル-(2-6C) アルカノイルアミノ、 $\underline{\text{N}}$ -(1-6C) アルキルスルファモイル、 $\underline{\text{N}}, \underline{\text{N}}$ -ジ-[(1-6C) アルキル] スルファモイル、(1-6C) アルカンスルホニルアミノ及び $\underline{\text{N}}$ -(1-6C) アルキル-(1-

6C) アルカンスルホニルアミノから、あるいは式：

$-X^4-R^{13}$

{ 式中、 X^4 は直接結合であるか、またはO及びN(R^{14}) から選択され、ここで R^{14} は水素または(1-6C)アルキルであり、 R^{13} は、ハロゲノ-(1-6C)アルキル、ヒドロキシ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ-(1-6C)アルキル、シアノ-(1-6C)アルキル、カルボキシ-(1-6C)アルキル、アミノ-(1-6C)アルキル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルアミノ-(1-6C)アルキル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ-(1-6C)アルキル、カルバモイル-(1-6C)アルキル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルカルバモイル-(1-6C)アルキル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル-(1-6C)アルキル、(2-6C)アルカノイル-(1-6C)アルキルまたは(1-6C)アルコキシカルボニル-(1-6C)アルキルから選択される } の基から、あるいは式：

$-Q^5$

{ 式中、 Q^5 はアリール、ヘテロサイクリル若しくはヘテロサイクリルから選択され、この Q^5 基は、場合により、ハロゲノ、ヒドロキシ、(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ、アミノ、(1-6C)アルキルアミノ及びジ-[(1-6C)アルキル]アミノから選択される、同一または異なっている置換基により置換されている } の基から選択される、同一または異なっている置換基を保持する、

ここでアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリル基以外の、 Q^4 -Z-基内の任意の CH_2 または CH_3 基は、場合により、その CH_2 または CH_3 基の上に、一つ以上のハロゲノまたは(1-6C)アルキル置換基を保持する、

Q^4 -Z-基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合により1または2個のオキソまたはチオキソ置換基を保持する；

但し、 Q^1 がヒドロキシ、イソインドリルまたは式(i)の基であるとき、 y は1ではない]

。

【請求項2】

R^1 が水素と(1-3C)アルキルから選択される、請求項1に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項3】

R^1 が水素である、請求項2に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項4】

R^2 が水素及び(1-3C)アルキルから選択される、請求項1～3のいずれか1項に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

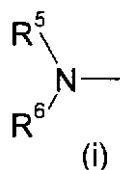
【請求項5】

R^2 が水素である、請求項4に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項6】

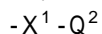
式中、 L は $-(CR^3R^4)_y-$ であり、ここで y は1、2、3若しくは4であり、且つ R^3 及び R^4 はそれぞれ独立して、水素及び(1-6C)アルキルから選択され、ここで Q^1 は、ヒドロキシ、イソインドリル及び(1-6C)アルキルから選択されるか、または Q^1 は、式(i)：

【化3】



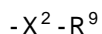
の基であり、ここで R^5 及び R^6 は、独立して水素、(1-6C)アルキル、(2-6C)アルカノイル及び(1-6C)アルコキシカルボニルから選択されるか、または R^5 及び R^6 はこれらが結合している窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素及び硫黄から独立して選択される一つ以上の追加のヘテロ原子を場合により含む4、5、6または7員のヘテロサイクリル基を形成する、

ここで(3-8C)シクロアルキル、(3-8C)シクロアルケニルまたはヘテロサイクリル基以外の Q^1 -L-基内の任意の CH_2 または CH_3 基は、場合により、それぞれの CH_2 または CH_3 基の上に、同一または異なっているもよい、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルスルホニルオキシ、(1-6C)アルキルスルフィニルオキシ、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルカルバモイル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキルスルファモイル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及び \underline{N} -(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノから、あるいは式：

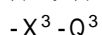


{ 式中、 X^1 は直接結合であるか、またはO、S、SO、SO₂、N(R⁸)、CO、CH(OR⁸)、CON(R⁸)、N(R⁸)CO、SO₂N(R⁸)、N(R⁸)SO₂、C(R⁸)₂O、C(R⁸)₂S及びN(R⁸)C(R⁸)₂から選択され、ここでR⁸はそれぞれ独立して水素または(1-6C)アルキルであり、及び Q^2 は、アリール、アリール-(1-6C)アルキル、(3-8C)シクロアルキル、(3-8C)シクロアルケニル-(1-6C)アルキル、(3-8C)シクロアルケニル、(3-8C)シクロアルケニル-(1-6C)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(1-6C)アルキル、ヘテロサイクリル若しくはヘテロサイクリル-(1-6C)アルキルから選択され、

ここで Q^1 -L-基内の任意の(3-8C)シクロアルキル、(3-8C)シクロアルケニル、ヘテロサイクリル、アリールまたはヘテロアリール基は、場合により、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、ホルミル、(1-6C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ、(2-6C)アルキニルオキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルカルバモイル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、アミノ(2-6C)アルカノイル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルアミノ(2-6C)アルカノイル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ(2-6C)アルカノイル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルスルファモイル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及び \underline{N} -(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノから選択される一つ以上の置換基を保持する}の基から、あるいは式：



{ 式中、 X^2 は直接結合であるか、またはO及びN(R¹⁰)から選択され、ここでR¹⁰は水素または(1-6C)アルキルであり、及びR⁹は、ハロゲン-(1-6C)アルキル、ヒドロキシ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ-(1-6C)アルキル、シアノ-(1-6C)アルキル、カルボキシ-(1-6C)アルキル、アミノ-(1-6C)アルキル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルアミノ-(1-6C)アルキル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ-(1-6C)アルキル、カルバモイル-(1-6C)アルキル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルカルバモイル-(1-6C)アルキル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル-(1-6C)アルキル、(2-6C)アルカノイル-(1-6C)アルキルまたは(1-6C)アルコキシカルボニル-(1-6C)アルキルから選択される}の基から、あるいは式：



{ 式中、 X^3 は直接結合であるか、またはO、CO及びN(R¹¹)から選択され、ここでR¹¹は水素または(1-6C)アルキルであり、及び Q^3 は、アリール、アリール-(1-6C)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール-(1-6C)アルキル、(3-8C)シクロアルキル、(3-8C)シクロアルケニル-(1-6C)アルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリル-(1-6C)アルキルから選択され、この Q^3 基は、場合によりハロゲン、(1-6C)アルキル及び(1-6C)アルコキシから選択される、同一または異なっているもよい、一つ以上の置換基を保持する}の基から選択される、同一または異なっているもよい、一つ以上の置換基を保持し、

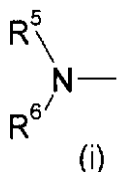
ここで Q^1 -L-基内の任意のヘテロサイクリルまたはイソインドリル基は、1または2個

のオキソまたはチオキソ置換基を保持する、請求項 1 ~ 5 のいずれか1項に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 7】

式中、 Q^1 はヒドロキシ、イソインドリル及び(1-4C)アルキルから選択されるか、または Q^1 は式 (i) :

【化 4】



の基であり、ここで R^5 及び R^6 は、独立して水素、(1-4C)アルキル及び(2-4C)アルカノイルから選択されるか、または R^5 及び R^6 はこれらが結合している窒素原子と一緒にあって、窒素及び酸素から独立して選択される一つ以上の追加のヘテロ原子を場合により含む 5、6 または 7 員のヘテロサイクリル基を形成する、

ここでヘテロサイクリル基以外の Q^1 -L-基内の任意の CH_2 または CH_3 基は、場合により、それぞれの CH_2 または CH_3 基の上に、同一または異なってもよい、ハロゲン、ヒドロキシ、(1-4C)アルコキシ、(1-4C)アルキルスルホニルオキシ及び(2-4C)アルカノイルから選択される一つ以上の置換基を保持し、

ここで Q^1 -L-基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合により、同一または異なってもよい、ヒドロキシ及び(1-4C)アルキルから、あるいは式 :



{ 式中、 X^2 は直接結合であり、ここで R^9 は、ヒドロキシ-(1-4C)アルキル及び(1-4C)アルコキシ-(1-4C)アルキルである } の基から、あるいは式 :



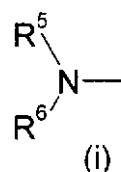
{ 式中、 X^3 は直接結合であり、 Q^3 は(3-8C)シクロアルキルである } の基から選択される、同一または異なってもよい、一つ以上の置換基を保持し、

ここで Q^1 -L-基内の任意のヘテロサイクリルまたはイソインドリル基は、1 または 2 個のオキソ置換基を保持する、請求項 6 に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 8】

式中、 Q^1 は式 (i) :

【化 5】



の基であり、{ 式中、 R^5 及び R^6 は独立して水素、(1-4C)アルキル及び(2-4C)アルカノイルから選択されるか、 R^5 及び R^6 はこれらが結合している窒素原子と一緒にあって、窒素及び酸素から独立して選択される一つ以上の追加のヘテロ原子を場合により含む、飽和 5、6 または 7 員のヘテロサイクリル基を形成する、

ここでヘテロサイクリル基以外の Q^1 -L-基内の任意の CH_2 または CH_3 基は、場合により、それぞれの CH_2 または CH_3 基の上に、同一または異なってもよい、ハロゲン、ヒドロキシ、(1-4C)アルコキシ、(1-4C)アルキルスルホニルオキシ及び(2-4C)アルカノイルから選択される一つ以上の置換基を保持し、

ここで Q^1 -L-基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合により、ヒドロキシ及び(1-4C)アルキルから、あるいは式 :

$-X^2-R^9$

{ 式中、 X^2 は直接結合であり、ここで R^9 は、ヒドロキシ-(1-4C)アルキル及び(1-4C)アルコキシ-(1-4C)アルキルから選択される } の基から、あるいは式：

$-X^3-Q^3$

{ 式中、 X^3 は直接結合であり、 Q^3 は(3-6C)シクロアルキルである } の基から選択される、同一または異なっているいてもよい、一つ以上の置換基を保持し、

ここで Q^1 -L-基内の任意のヘテロサイクリル基は、1または2個のオキソ置換基を保持する、請求項6または7に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項9】

Lが $-(CH_2)_y-$ (式中、yは1、2または3である)である、請求項1～8のいずれか1項に記載のピラゾロピリミジン化合物。

【請求項10】

Q^1 -L-基が、2-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、2-クロロエチル、3-クロロプロピル、2-(メタンスルホニルオキシ)エチル、2-アミノエチル、2-(メチルアミノ)エチル、2-[(2-ヒドロキシエチル)アミノ]エチル、2-[(2-ヒドロキシエチル)(メチル)アミノ]エチル、2-[ジ-(2-ヒドロキシエチル)アミノ]エチル、2-[(2-メトキシエチル)(メチル)アミノ]エチル、2-(2-ヒドロキシ-N-メチルアセトアミド)エチル、2-[(2-ヒドロキシエチル)アセトアミド]エチル、2-ピロリジン-1-イルエチル、3-ピロリジン-1-イルプロピル、2-(2-オキソピロリジン-1-イル)エチル、2-(2-ヒドロキシメチルピロリジン-1-イル)エチル、3-(2-ヒドロキシメチルピロリジン-1-イル)プロピル、2-(2-メトキシメチルピロリジン-1-イル)エチル、2-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)エチル、2-ピペラジン-1-イルエチル、2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチル、3-(4-メチルピペラジン-1-イル)プロピル、2-(4-エチルピペラジン-1-イル)エチル、2-(4-イソプロピルピペラジン-1-イル)エチル、2-(4-シクロプロピルピペラジン-1-イル)エチル、2-(2-オキソピペラジン-4-イル)エチル、2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)エチル、3-(4-アセチルピペラジン-1-イル)プロピル、2-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)エチル、3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)プロピル、2-(4-フルオロピペリジン-1-イル)エチル、2-モルホリン-4-イルエチル、2-(3-オキソモルホリン-4-イル)エチル、3-モルホリン-4-イルプロピル、2-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)エチル、2-(1,3-ジオキソ-イソインドール-2-イル)エチル、2-(4-メトキシピペリジン-1-イル)エチル、2-(2,4-ジオキソ-イミダゾリジン-3-イル)エチル及び2-(1,4-オキサゼパン-4-イル)エチルから選択される、請求項6または7に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項11】

G^1 及び G^2 が両方とも水素である、請求項1～10のいずれか1項に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項12】

G^3 及び G^4 の一方が水素であり、且つ他方は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、(1-6C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ及び(2-6C)アルキニルオキシから選択される、請求項1～11のいずれか1項に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項13】

G^3 及び G^4 の一方が水素であり、且つ他方は、水素、ハロゲン、(1-6C)アルキル及び(1-6C)アルコキシから選択される、請求項12に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項14】

式中、Zは直接結合であるか、またはO、S、SO、SO₂、N(R¹²)、CH(OR¹²)、CO、CON(R¹²)、N(R¹²)CO、SO₂N(R¹²)、N(R¹²)SO₂、C(R¹²)₂、OC(R¹²)₂、C(R¹²)₂O、SC(R¹²)₂、C(R¹²)₂S、CO、C(R¹²)₂N(R¹²)及びN(R¹²)C(R¹²)₂から選択され、ここでR¹²はそれぞれ独立して、

水素または(1-6C)アルキルであり、

ここで Q^4 は、フェニル及び5または6員の単環式ヘテロアリール環から選択され、このヘテロアリール環は、酸素、窒素及び硫黄から独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含み、

ここで Q^4 は、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、ホルミル、カルバモイル、スルファモイル、メルカプト、(1-6C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ、(2-6C)アルキニルオキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルカルバモイル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキルスルファモイル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及び \underline{N} -(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノから、あるいは式：

$-X^4-R^{13}$

{ 式中、 X^4 は直接結合であるか、またはO及びN(R^{14})から選択され、ここで R^{14} は水素または(1-6C)アルキルであり、 R^{13} は、ハロゲン-(1-6C)アルキル、ヒドロキシ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ-(1-6C)アルキル、シアノ-(1-6C)アルキル、カルボキシ-(1-6C)アルキル、アミノ-(1-6C)アルキル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルアミノ-(1-6C)アルキル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ-(1-6C)アルキル、カルバモイル-(1-6C)アルキル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルカルバモイル-(1-6C)アルキル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル-(1-6C)アルキル、(2-6C)アルカノイル-(1-6C)アルキルまたは(1-6C)アルコキシカルボニル-(1-6C)アルキルから選択される}の基から、あるいは式：

$-Q^5$

{ 式中、 Q^5 はアリール、ヘテロアリール若しくはヘテロサイクリルから選択され、この Q^5 基は、場合により、ハロゲン、ヒドロキシ、(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ、アミノ、(1-6C)アルキルアミノ及びジ-[(1-6C)アルキル]アミノから選択される、同一または異なっているいてもよい、一つ以上の置換基により置換されている}の基から選択される、同一または異なっているいてもよい、一つ以上の置換基を保持する、

ここでアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリル基以外の、 Q^4 -Z-基内の任意の CH_2 または CH_3 基は、場合により、その CH_2 または CH_3 基の上に、一つ以上のハロゲンまたは(1-6C)アルキル置換基を保持する、

及び、 Q^4 -Z-基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合により1または2個のオキソまたはチオキソ置換基を保持する、請求項1～13のいずれか1項に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項15】

式中、 Q^4 は、フェニル及び5または6員の単環式ヘテロアリール環から選択され、このヘテロアリール環は、酸素、窒素及び硫黄から独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含み、

ここで Q^4 は、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、ホルミル、カルバモイル、スルファモイル、メルカプト、(1-6C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ、(2-6C)アルキニルオキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルカルバモイル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキルスルファモイル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及び \underline{N} -(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノから選択される、同一または異なっているいてもよい、一つ以上の置換基を場合により保持し、

ここでアリールまたはヘテロアリール基以外の、 Q^4 -Z-基内の任意の CH_2 または CH_3 基は、場合により、その CH_2 または CH_3 基の上に、一つ以上のハロゲンまたは(1-6C)アルキル置換基を保持する、請求項 1 4 に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 6】

式中、 Q^4 は、フェニル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、1,3-チアゾリル、1H-イミダゾリル、1H-ピラゾリル、1,3-オキサゾリル及びイソキサゾリルから選択され、

ここで、 Q^4 は場合により、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、ビニル、アリル、エチニル、2-プロピニル、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、アセチル、プロピオニル、メチルアミノ、エチルアミノ、 N,N -ジメチルアミノ、 N,N -ジエチルアミノ、 N -メチル- N -エチルアミノ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、カルバモイル、 N -メチルカルバモイル、 N,N -ジメチルカルバモイル、アセトキシ、アセトアミド、フルオロメチル、2-フルオロエチル、クロロメチル、2-クロロエチル、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、メトキシメチル、2-メトキシエチル、シアノメチル、2-シアノエチル、カルボキシメチル、2-カルボキシメチル、アミノメチル、メチルアミノメチル、エチルアミノメチル、 N,N -ジメチルアミノメチル、 N,N -ジエチルアミノメチル、 N -メチル- N -エチルアミノメチル、2-アミノエチル、2-(メチルアミノ)エチル、2-(エチルアミノ)エチル、2-(N,N -ジメチルアミノ)エチル、2-(N,N -ジエチルアミノ)エチル、2-(N -メチル- N -エチルアミノ)エチル、カルバモイルメチル、 N -メチルカルバモイルメチル及び N,N -ジメチルカルバモイルメチルから選択される、同一または異なっているもよい 1 つ以上の置換基を保持する、請求項 1 4 または 1 5 に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 7】

Q^4 は、フェニル及びピリジニルから選択され、 Q^4 は場合により、フルオロ、クロロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシ及びエトキシから選択される、同一または異なっているもよい、1 つ以上の置換基を保持する、請求項 1 4 ~ 1 6 のいずれか 1 項に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 8】

Q^4 は、フェニル、3-フルオロフェニル、ピリジン-2-イル及び6-メチルピリジン-3-イルから選択される、請求項 1 7 に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 1 9】

Zは、O及び $OC(R^{12})_2$ から選択され、ここで R^{12} はそれぞれ独立して、水素または(1-3C)アルキルである、請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 2 0】

以下のもの：

2-{{4-({3-クロロ-4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]フェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}オキシ}エタノール；

2-{{4-({4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メチルフェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}オキシ}エタノール；

2-{{4-({4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メトキシフェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}オキシ}エタノール；

2-{{4-({3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}オキシ}エタノール；

2-{{4-({3-メチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}オキシ}エタノール；

2-[(4-{[3-エチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エタノール；

2-[(4-{[3-メトキシ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エタノール；

2-{[4-({[3-メチル-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル]アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エタノール；

2-{[4-({[3-クロロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル]アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エタノール；

2-{[4-({[3-フルオロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル]アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エタノール；

3-[(4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]プロパン-1-オール；

3-(2-クロロエトキシ)-N-{3-クロロ-4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]フェニル}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

3-(2-クロロエトキシ)-N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

3-(2-クロロエトキシ)-N-[3-メチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

3-(2-クロロエトキシ)-N-{3-メチル-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

3-(2-クロロエトキシ)-N-{3-クロロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

3-(3-クロロプロポキシ)-N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

2-[(4-{[3-メトキシ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチルメタンスルホネート；

2-[(4-{[3-エチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチルメタンスルホネート；

2-{[4-({[3-フルオロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル]アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチルメタンスルホネート；

2-{[4-({[4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メチルフェニル]アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチルメタンスルホネート；

2-{[4-({[4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メトキシフェニル]アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチルメタンスルホネート；

N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-(2-ピロリジン-1-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-[2-(メチルアミノ)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

4-{2-[(4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチル}ピペラジン-2-オン；

N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-(2-モルホリン-4-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

2-[(2-[(4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチル)(メチル)アミノ]エタノール；

N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

((2R)-1-{2-[(4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチル}ピロリジン-2-イル)メタノール；

((2S)-1-{2-[(4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチル}ピロリジン-2-イル)メタノール；

1-{2-[4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチル}ピペリジン-4-オール;

2,2'-(2-[4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチル)イミノ)ジエタノール;

3-[2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

(3S)-1-{2-[4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチル}ピロリジン-3-オール;

(3R)-1-{2-[4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチル}ピロリジン-3-オール;

2-({2-[4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチル)アミノ)エタノール;

N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-[2-(4-エチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-[2-(4-イソプロピルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-(2-ピペラジン-1-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-{3-メチル-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-(2-ピロリジン-1-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

4-(2-{[4-{[3-メチル-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル)ピペラジン-2-オン;

N-{3-メチル-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-(2-モルホリン-4-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-{3-メチル-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

[(2R)-1-(2-{[4-{[3-メチル-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル)ピロリジン-2-イル]メタノール;

[(2S)-1-(2-{[4-{[3-メチル-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル)ピロリジン-2-イル]メタノール;

1-(2-{[4-{[3-メチル-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル)ピペリジン-4-オール;

3-[2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-N-{3-メチル-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

(2S)-1-(2-{[4-{[3-メチル-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル)ピロリジン-2-オール;

(2R)-1-(2-{[4-{[3-メチル-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル)ピロリジン-2-オール;

N-{3-クロロ-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-(2-モルホリン-4-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-{3-クロロ-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-(2-ピロリジン-1-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-{3-クロロ-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

1-(2-{[4-{[3-クロロ-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル)ピペリジン-4-オール;

3-[2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-N-{3-クロロ-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

[(2R)-1-(2-{[4-{[3-フルオロ-4-[6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル)ピロリジン-2-イル]メタノール

;

N-{3-フルオロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-(2-ピロリジン-1-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-{3-フルオロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

1-(2-{[4-({3-フルオロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}オキシ}エチル)ピペリジン-4-オール;

N-{3-フルオロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-(2-モルホリン-4-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-{3-クロロ-4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]フェニル}-3-[2-(メチルアミノ)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-{3-クロロ-4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]フェニル}-3-(2-ピロリジン-1-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-{3-クロロ-4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]フェニル}-3-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

1-(2-{[4-({3-クロロ-4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]フェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}オキシ}エチル)ピペリジン-4-オール;

N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-(3-ピロリジン-1-イルプロボキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-(3-モルホリン-4-イルプロボキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

1-{3-[(4-({3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]プロピル}ピペリジン-4-オール;

3-[3-(4-アセチルピペラジン-1-イル)プロボキシ]-N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)プロボキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

((2R)-1-{3-[(4-({3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]プロピル}ピロリジン-2-イル)メタノール;

N-[3-メチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-(2-ピロリジン-1-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

3-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-N-[3-メチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

1-{2-[(4-({3-メチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチル}ピペリジン-4-オール;

N-[3-メチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-(2-モルホリン-4-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-[3-メトキシ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-(2-ピロリジン-1-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-[3-メトキシ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

1-{2-[(4-({3-メトキシ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチル}ピペリジン-4-オール;

((2R)-1-{2-[(4-({3-メトキシ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチル}ピロリジン-2-イル)メタノール;

N-{4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メトキシフェニル}-3-(2-ピロリジン-1-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

N-{4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メトキシフェニル}-3-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン;

1-(2-{[4-({4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メトキシフェニル}アミノ)-1H-ピラゾ

ロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}オキシ}エチル)ピペリジン-4-オール；

[(2R)-1-(2-{[4-({4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メトキシフェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}オキシ}エチル)ピロリジン-2-イル]メタノール；

N-{4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メチルフェニル}-3-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

1-(2-{[4-({4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メチルフェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}オキシ}エチル)ピペリジン-4-オール；

[(2R)-1-(2-{[4-({4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メチルフェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}オキシ}エチル)ピロリジン-2-イル]メタノール；

N-(2-{[4-({3-クロロ-4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]フェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}オキシ}エチル)-2-ヒドロキシ-N-メチルアセトアミド；

N-{2-[(4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル}-2-ヒドロキシ-N-メチルアセトアミド；

N-{2-[(4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル}-N-(2-ヒドロキシエチル)アセトアミド；

4-{2-[(4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル}モルホリン-3-オン；

3-{2-[(4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル}-1,3-オキサゾリジン-2-オン；

2-{2-[(4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル}-1H-イソインドール-1,3(2H)-ジオン；

3-(2-アミノエトキシ)-N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

1-{2-[(4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル}ピロリジン-2-オン；

3-{2-[(4-{[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル}イミダゾリジン-2,4-ジオン；

((2R)-1-{2-[(4-{[3-エチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル}ピロリジン-2-イル)メタノール；

N-[3-エチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-(2-ピロリジン-1-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-[3-エチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

1-{2-[(4-{[3-エチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル}ピペリジン-4-オール；

N-[3-エチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-(2-モルホリン-4-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-[2-(4-フルオロピペリジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-{3-クロロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-[2-(4-エチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-{3-クロロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-[2-(4-イソプロピルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-{3-クロロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-[2-(4-シクロプロピルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-{3-クロロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-[2-(4-フルオロピペリジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

[(2R)-1-(2-{[4-({3-クロロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}オキシ}エチル)ピロリジン-2-イル]メタノール；

N-{3-クロロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-{2-[(2R)-2-(メトキ

シメチル)ピロリジン-1-イル]エトキシ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

2-[(2-{[4-({3-クロロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}アミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ}エチル)(メチル)アミノ]エタノール；

N-{3-クロロ-4-[(6-メチルピリジン-3-イル)オキシ]フェニル}-3-{2-[(2-メトキシエチル)(メチル)アミノ]エトキシ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-[4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メチルフェニル]-3-[2-(4-エチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

2-[(4-{[4-(ベンジルオキシ)-3-メチルフェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エタノール；

2-[(4-{[4-(ベンジルオキシ)-3-メチルフェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチルメタンスルホネート；

N-[4-(ベンジルオキシ)-3-メチルフェニル]-3-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-[4-(ベンジルオキシ)-3-メチルフェニル]-3-[2-(4-エチルピペラジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

1-{2-[(4-{[4-(ベンジルオキシ)-3-メチルフェニル]アミノ}-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)オキシ]エチル}ピペリジン-4-オール；

N-[4-(ベンジルオキシ)-3-メチルフェニル]-3-(2-モルホリン-4-イルエトキシ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-[2-(1,4-オキサゼパン-4-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-[4-(ベンジルオキシ)-3-メチルフェニル]-3-[2-(1,4-オキサゼパン-4-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-{4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メチルフェニル}-3-[2-(1,4-オキサゼパン-4-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-{4-[(3-フルオロベンジル)オキシ]-3-メチルフェニル}-3-[2-(4-メトキシピペリジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；

N-[3-クロロ-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]-3-[2-(4-メトキシピペリジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミン；及び

N-[4-(ベンジルオキシ)-3-メチルフェニル]-3-[2-(4-メトキシピペリジン-1-イル)エトキシ]-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-アミンの一つ以上から選択される、式 I のピラゾロピリミジン化合物 またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 2 1】

医薬的に許容可能な希釈剤またはキャリアと組み合わせた、請求項 1 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の式 I のピラゾロピリミジン化合物、またはその医薬的に許容可能な塩を含む、医薬組成物。

【請求項 2 2】

請求項 1 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の式 I のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩と、ガンの共同処置のための追加の抗腫瘍剤とを含む、医薬製品。

【請求項 2 3】

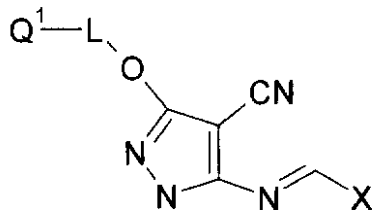
薬剤として使用するための、請求項 1 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の式 I のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 2 4】

請求項 1 に定義される式 I のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩の 製造方法 であって、

(a) 式 II：

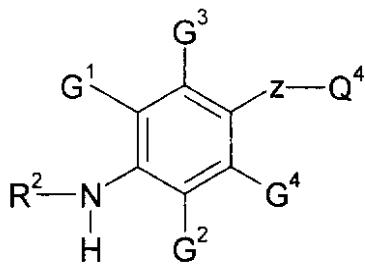
【化 6】



II

{ 式中、Xは-NR₂または-ORを表し、Rは(1-6C)アルキルを表し、Q¹及びLは、必要により全ての官能基を保護した以外には、請求項1の定義の意味のいずれかを有する } の化合物と、式III：

【化 7】



III

{ 式中、R²、G¹、G²、G³、G⁴、Z及びQ⁴は、必要により全ての官能基を保護した以外には、請求項1の定義の意味のいずれかを有する } のアニリンとの反応；

その後、必要により：

(i) 式Iのピラゾロピリミジン化合物を、式Iの別のピラゾロピリミジン化合物に転換する；及び/または

(ii) 慣用手段によって、存在する全ての保護基を除去する；及び/または

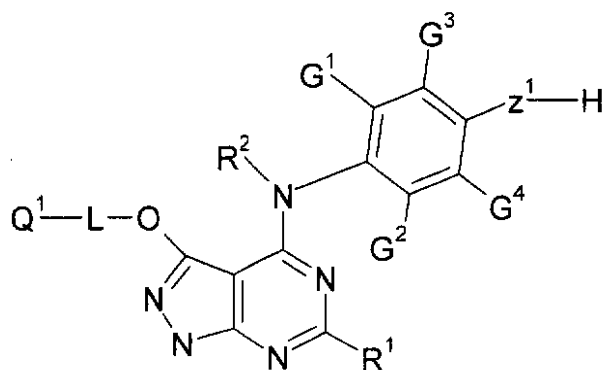
(iii) 医薬的に許容可能な塩を形成する、各段階を含む、前記製造方法。

【請求項 25】

請求項1に定義される式I { 但し、式中、ZはOC(R¹²)₂、SC(R¹²)₂またはN(R¹²)C(R¹²)₂である } のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩の製造方法であって、

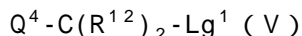
(b) 式IV：

【化 8】



IV

{ 式中、 Z^1 はO、Sまたは $N(R^{12})$ であり、 R^1 、 R^2 、 R^{12} 、L、 Q^1 、 G^1 、 G^2 、 G^3 及び G^4 は、必要により全ての官能基を保護した以外には、請求項1の定義の意味のいずれかを有する } の化合物と、式V：



{ 式中、 Lg^1 は好適な置換可能な基であり、 Q^4 及び R^{12} は、必要により全ての官能基を保護した以外には、請求項1の定義の意味のいずれかを有する } の化合物の反応；

その後、必要により：

(i) 式Iのピラゾロピリミジン化合物を、式Iの別のピラゾロピリミジン化合物に転換する；及び/または

(ii) 慣用手段によって、存在する全ての保護基を除去する；及び/または

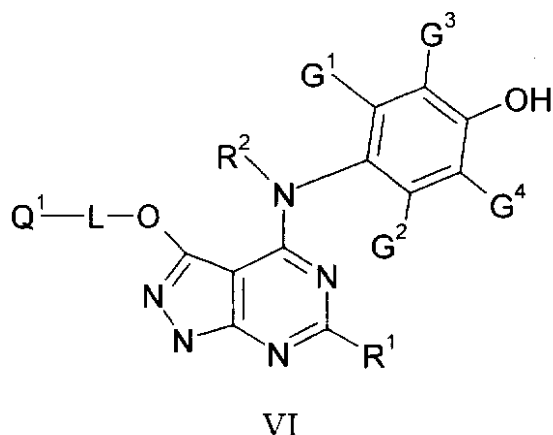
(iii) 医薬的に許容可能な塩を形成する、各段階を含む、前記製造方法。

【請求項26】

請求項1に定義される式I { 但し、式中、ZはOであり、 Q^4 は2-ピリジル、4-ピリジル、2-ピリミジル、4-ピリミジル、2-ピラジニルまたは3-ピリダジニルである } のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩の製造方法であって、

(c) 式VI：

【化9】



{ 式中、 R^1 、 R^2 、 Q^1 、L、 G^1 、 G^2 、 G^3 及び G^4 は、必要により全ての官能基を保護した以外には、請求項1の定義の意味のいずれかを有する } の化合物と、2-ブロモピリジン、4-ブロモピリジン、2-クロロピリミジン、4-クロロピリミジン、2-クロロピラジンまたは3-クロロピリダジンとの反応；

その後、必要により：

(i) 式Iのピラゾロピリミジン化合物を、式Iの別のピラゾロピリミジン化合物に転換する；及び/または

(ii) 慣用手段によって、存在する全ての保護基を除去する；及び/または

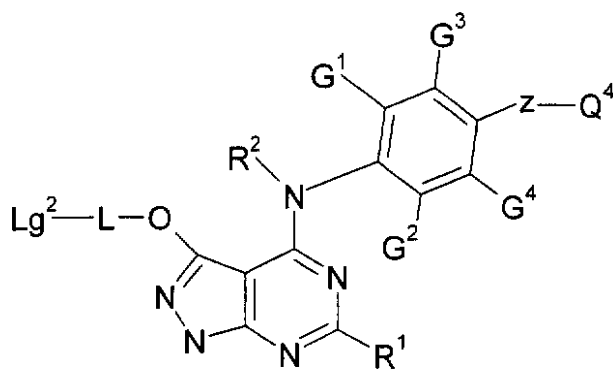
(iii) 医薬的に許容可能な塩を形成する、各段階を含む、製造方法。

【請求項27】

請求項1に定義される式I { 但し、式中、 Q^1 は、請求項1に定義の式(i)の基である } のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩の製造方法であって、

(d) 式VII：

【化 1 0】



VII

{ 式中、 Lg^2 は好適な置換可能な基であり、 R^1 、 R^2 、 L 、 G^1 、 G^2 、 G^3 、 G^4 、 Z 及び Q^4 は、必要により全ての官能基を保護した以外には、請求項1の定義の意味のいずれかを有する } の化合物と、式VIII：

$H-NR^5R^6$ (VIII)

{ 式中、 R^5 及び R^6 は、必要により全ての官能基を保護した以外には、請求項1の定義の意味のいずれかを有する } のアミンとの反応；

その後、必要により：

(i) 式Iのピラゾロピリミジン化合物を、式Iの別のピラゾロピリミジン化合物に転換する；及び/または

(ii) 慣用手段によって、存在する全ての保護基を除去する；及び/または

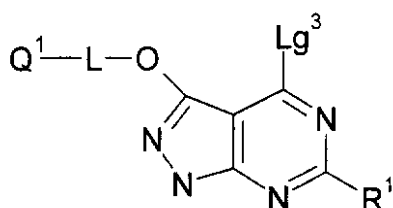
(iii) 医薬的に許容可能な塩を形成する、各段階を含む、製造方法。

【請求項 2 8】

請求項 1 に定義される式Iのピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩の製造方法であって、

(e) 式IX：

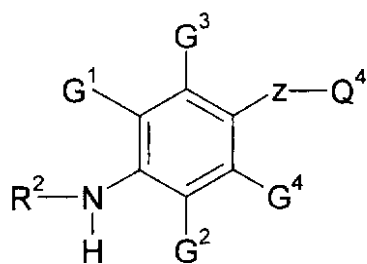
【化 1 1】



IX

{ 式中、 Lg^3 は好適な置換可能な基であり、 R^1 、 Q^1 及び L は、必要により全ての官能基を保護した以外には、請求項1の定義の意味のいずれかを有する } の化合物と、式III：

【化 1 2】



III

{ 式中、R²、G¹、G²、G³、G⁴、Z及びQ⁴は、必要により全ての官能基を保護した以外には、請求項1の定義の意味のいずれかを有する } のアニリンとの反応；

その後、必要により；

(i) 式 I のピラゾロピリミジン化合物を、式 I の別のピラゾロピリミジン化合物に転換する；及び / または

(ii) 慣用手段によって、存在する全ての保護基を除去する；及び / または

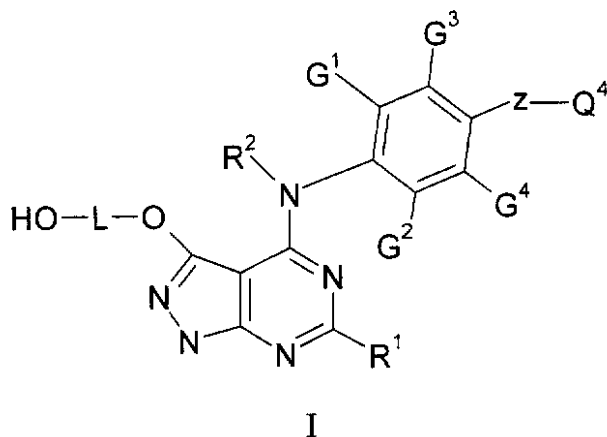
(iii) 医薬的に許容可能な塩を形成する、各段階を含む、製造方法。

【請求項 2 9】

請求項 1 に定義される式 I のピラゾロピリミジン化合物またはその医薬的に許容可能な塩の製造方法であって、

(f) 式 I：

【化 1 3】



I

{ 式中、Q¹はヒドロキシであり、R¹、R²、L、G¹、G²、G³、G⁴、Z及びQ⁴は、必要により全ての官能基を保護した以外には、請求項1の定義の意味のいずれかを有する } の化合物と、ミツノブ反応に好適な求核性試薬 { 必要により全ての官能基は保護する } との反応；その後、必要により；

(i) 式 I のピラゾロピリミジン化合物を、式 I の別のピラゾロピリミジン化合物に転換する；及び / または

(ii) 慣用手段によって、存在する全ての保護基を除去する；及び / または

(iii) 医薬的に許容可能な塩を形成する、各段階を含む、前記製造方法。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 6 1

【訂正方法】変更

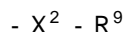
【訂正の内容】

【 0 0 6 1 】

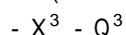
の基であり、ここで R^5 及び R^6 は独立して水素、(1-4C)アルキル及び(2-4C)アルカノイルから選択されるか、または R^5 及び R^6 はこれらが結合している窒素原子と一緒にあって、窒素及び酸素から独立して選択される、一つ以上の追加のヘテロ原子を場合により含む、飽和5、6または7(特に5または6)員のヘテロサイクリル基を形成する、

及びヘテロサイクリル基以外の Q^1 -L-基内の任意の CH_2 または CH_3 基は、場合によりそれぞれの CH_2 または CH_3 基上に、ハロゲン、ヒドロキシ、(1-4C)アルコキシ、(1-4C)アルキルスルホニルオキシ及び(2-4C)アルカノイルから選択される、同一または異なっているいてもよい、一つ以上(たとえば1または2個)の置換基を保持する、

及び Q^1 -L-基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合により、ヒドロキシ及び(1-4C)アルキルから、または式：



{ 式中、 X^2 は直接結合であり、及び R^9 はヒドロキシ-(1-4C)アルキル及び(1-4C)アルコキシ-(1-6C)アルキルから選択される } の基から、または式：



{ 式中、 X^3 は直接結合であり、及び Q^3 は(3-6C)シクロアルキルである } の基から選択される、同一または異なっているいてもよい、一つ以上(たとえば1、2または3個)の置換基を保持する、

及び Q^1 -L-基内の任意のヘテロサイクリル基は、場合により1または2個のオキソまたはチオキソ置換基を保持する；

(w)Lは $-(CH_2)_y-$ であり、ここでyは1、2または3から選択され、及び Q^1 は(h)~(v)で定義した通りであり、但し Q^1 がヒドロキシ、イソインドリルまたは式(i)の基であるとき、yは1ではない；

(x) Q^1 -L-基は、2-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、2-クロロエチル、3-クロロプロピル、2-(メタンスルホニルオキシ)エチル、2-アミノエチル、2-(メチルアミノ)エチル、2-[(2-ヒドロキシエチル)アミノ]エチル、2-[(2-ヒドロキシエチル)(メチル)アミノ]エチル、2-[ジ-(2-ヒドロキシエチル)アミノ]エチル、2-[(2-メトキシエチル)(メチル)アミノ]エチル、2-(2-ヒドロキシ-N-メチルアセトアミド)エチル、2-[(2-ヒドロキシエチル)アセトアミド]エチル、2-ピロリジン-1-イルエチル、3-ピロリジン-1-イルプロピル、2-(2-オキソピロリジン-1-イル)エチル、2-(2-ヒドロキシメチルピロリジン-1-イル)エチル、3-(2-ヒドロキシメチルピロリジン-1-イル)プロピル、2-(2-メトキシメチルピロリジン-1-イル)エチル、2-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)エチル、2-ピペラジン-1-イルエチル、2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチル、3-(4-メチルピペラジン-1-イル)プロピル、2-(4-エチルピペラジン-1-イル)エチル、2-(4-イソプロピルピペラジン-1-イル)エチル、2-(4-シクロプロピルピペラジン-1-イル)エチル、2-(2-オキソピペラジン-4-イル)エチル、2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)エチル、3-(4-アセチルピペラジン-1-イル)プロピル、2-(4-ヒドロキシピペラジン-1-イル)エチル、3-(4-ヒドロキシピペラジン-1-イル)プロピル、2-(4-フルオロピペラジン-1-イル)エチル、2-モルホリン-4-イルエチル、2-(3-オキソモルホリン-4-イル)エチル、3-モルホリン-4-イルプロピル、2-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)エチル及び2-(1,3-ジオキソ-イソインドール-2-イル)エチルから選択される；

(y) Q^1 -L-基は、2-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、2-クロロエチル、3-クロロプロピル、2-(メタンスルホニルオキシ)エチル、2-アミノエチル、2-(メチルアミノ)エチル、2-[(2-ヒドロキシエチル)アミノ]エチル、2-[(2-ヒドロキシエチル)(メチル)アミノ]エチル、2-[ジ-(2-ヒドロキシエチル)アミノ]エチル、2-[(2-メトキシエチル)(メチル)アミノ]エチル、2-(2-ヒドロキシ-N-メチルアセトアミド)エチル、2-[(2-ヒドロキシエチル)アセトアミド]エチル、2-ピロリジン-1-イルエチル、3-ピロリジン-1-イルプロピル、2-(2-オキソピロリジン-1-イル)エチル、2-(2-ヒドロキシメチルピロリジン-1-イル)エチル、3-(2-ヒドロキシメチルピロリジン-1-イル)プロピル、2-(2-メトキシメチルピロリジン-1-イル)エチル、2-(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)エチル、2-ピペラジン-1-イル

エチル、2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチル、3-(4-メチルピペラジン-1-イル)プロピル、2-(4-エチルピペラジン-1-イル)エチル、2-(4-イソプロピルピペラジン-1-イル)エチル、2-(4-シクロプロピルピペラジン-1-イル)エチル、2-(2-オキソピペラジン-4-イル)エチル、2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)エチル、3-(4-アセチルピペラジン-1-イル)プロピル、2-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)エチル、3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)プロピル、2-(4-フルオロピペリジン-1-イル)エチル、2-モルホリン-4-イルエチル、2-(3-オキソモルホリン-4-イル)エチル、3-モルホリン-4-イルプロピル、2-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)エチル、2-(1,3-ジオキソ-イソインドール-2-イル)エチル、2-(4-メトキシピペリジン-1-イル)エチル、2-(2,4-ジオキソ-イミダゾリジン-3-イル)エチル及び2-(1,4-オキサゼパン-4-イル)エチルから選択される；

(z)G¹及びG²の少なくとも一つは水素である；

(aa)G¹及びG²は両方とも水素である；

(bb)G³及びG⁴の一方は水素であり、他方はハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、(1-6C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ、(2-6C)アルキニルオキシ、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、アリール及びヘテロアリールから選択され、

及びここで、G³またはG⁴内の任意のアリールまたはヘテロアリール基は、場合によりハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、(1-6C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ、(2-6C)アルキニルオキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ及びジ-[(1-6C)アルキル]アミノから選択される、同一または異なっているいてもよい、一つ以上（たとえば1、2または3個）の置換基を保持する；

(cc)G³及びG⁴はそれぞれ独立して、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、(1-6C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ及び(2-6C)アルキニルオキシから選択される；

(dd)G³及びG⁴の一方は水素であり、他方は水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、(1-6C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ及び(2-6C)アルキニルオキシから選択される；

(ee)G³及びG⁴はそれぞれ独立して、水素、ハロゲン、(1-6C)アルキル及び(1-6C)アルコキシ（特に水素、クロロ、フルオロ、(1-3C)アルキル及び(1-3C)アルコキシ）から選択される；

(ff)G³及びG⁴の一方は水素であり、他方は水素、ハロゲン、(1-6C)アルキル及び(1-6C)アルコキシから選択される；

(gg)G³及びG⁴はそれぞれ独立して、水素、クロロ、フルオロ、メチル、エチル及びメトキシから選択される；

(hh)G³及びG⁴の一方は水素であり、他方はクロロ、フルオロ、メチル、エチル及びメトキシから選択される；

(ii)G³及びG⁴の一方は水素であり、他方はクロロ及びメチルから選択される；

(jj)G³及びG⁴の一方は水素であり、他方はクロロである；

(kk)G³及びG⁴の一方は水素であり、他方はメチルである；

(ll)ZはO、S、SO、SO₂、N(R¹²)、CH(OR¹²)、CO、CON(R¹²)、N(R¹²)CO、SO₂N(R¹²)、N(R¹²)SO₂、C(R¹²)₂、OC(R¹²)₂、C(R¹²)₂O、SC(R¹²)₂、C(R¹²)₂S、CO、C(R¹²)₂N(R¹²)及びN(R¹²)C(R¹²)₂から選択され、ここでR¹²はそれぞれ独立して、水素または(1-3C)アルキルである；

(mm)ZはO及びOC(R¹²)₂から選択され、ここでR¹²はそれぞれ独立して水素または(1-3C)アルキル（特にR¹²はそれぞれ水素である）である；

(nn)ZはOである；

(oo)Zは $OC(R^{12})_2$ であり、ここで R^{12} はそれぞれ独立して、水素または(1-3C)アルキル(特に R^{12} はそれぞれ水素である)である；

(pp) Q^4 は、フェニル及び5または6員の単環式ヘテロアリールから選択され、このヘテロアリール環は、酸素、窒素及び硫黄から独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む、

ここで、 Q^4 は、場合によりハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、ホルミル、カルバモイル、スルファモイル、メルカプト、(1-6C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ、(2-6C)アルキニルオキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルカルバモイル、 \underline{N} , \underline{N} -ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキルスルファモイル、 \underline{N} , \underline{N} -ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及び \underline{N} -(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノから、または式：

- $X^4 - R^{13}$

{ 式中、 X^4 は直接結合であるか、またはO及びN(R^{14})から選択され、ここで R^{14} は水素または(1-6C)アルキルであり、及び R^{13} はハロゲン-(1-6C)アルキル、ヒドロキシ-(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ-(1-6C)アルキル、シアノ-(1-6C)アルキル、カルボキシ-(1-6C)アルキル、アミノ-(1-6C)アルキル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルアミノ-(1-6C)アルキル、 \underline{N} , \underline{N} -ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ-(1-6C)アルキル、カルバモイル-(1-6C)アルキル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルカルバモイル-(1-6C)アルキル、 \underline{N} , \underline{N} -ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル-(1-6C)アルキル、(2-6C)アルカノイル-(1-6C)アルキルまたは(1-6C)アルコキシカルボニル-(1-6C)アルキルから選択される}の基から、または式：

- Q^5

{ 式中、 Q^5 はアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルから選択され、ここで Q^5 基は場合により、ハロゲン、ヒドロキシ、(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ、アミノ、(1-6C)アルキルアミノ及びジ-[(1-6C)アルキル]アミノから選択される、同一または異なっているいてもよい、一つ以上の置換基により置換される}の基から選択される、同一または異なっているいてもよい、一つ以上(たとえば1、2または3個)の置換基を保持する、

及びアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリル基以外の Q^4 -Z-基内の任意の CH_2 または CH_3 基は、場合によりそれぞれの CH_2 または CH_3 基の上に、一つ以上のハロゲンまたは(1-6C)アルキル置換基を保持し、

及び Q^4 -Z-基内の任意のヘテロサイクリル基は場合により1または2個のオキソまたはチオキソ置換基を保持する；

(qq) Q^4 はフェニル及び、5または6員の単環式ヘテロアリール環から選択され、このヘテロアリール環は、酸素、窒素及び硫黄から選択される(特に酸素及び窒素から選択される、特に窒素)1個のヘテロ原子を含む、

及びここで Q^4 は、場合により(pp)で定義したような、同一または異なっているいてもよい、一つ以上(たとえば1、2または3個)の置換基を保持する；

(rr) Q^4 はフェニル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、1,3-チアゾリル、1H-イミダゾリル、1H-ピラゾリル、1,3-オキサゾリル及びイソキサゾリルから選択される、

及びここで Q^4 は場合により、(pp)で定義したような、同一または異なっているいてもよい、一つ以上(たとえば1、2または3個)の置換基を保持する；

(ss) Q^4 はフェニル及びピリジニル(たとえばピリジン-2-イルまたはピリジン-3-イル)から選択される、

及びここで、 Q^4 は場合により、(pp)で定義したような、同一または異なっているいてもよい、一つ以上(たとえば1、2または3個)の置換基を保持する；

(tt) Q^4 はフェニル及び、5または6員の単環式ヘテロアリール環から選択され、このヘテ

ロアリアル環は、酸素、窒素及び硫黄から独立して選択される 1、2 または 3 個のヘテロ原子を含む、

及びここで Q^4 は、場合により、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、ホルミル、カルバモイル、スルファモイル、メルカプト、(1-6C)アルキル、(2-8C)アルケニル、(2-8C)アルキニル、(1-6C)アルコキシ、(2-6C)アルケニルオキシ、(2-6C)アルキニルオキシ、(1-6C)アルキルチオ、(1-6C)アルキルスルフィニル、(1-6C)アルキルスルホニル、(1-6C)アルキルアミノ、ジ-[(1-6C)アルキル]アミノ、(1-6C)アルコキシカルボニル、 \underline{N} -(1-6C)アルキルカルバモイル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]カルバモイル、(2-6C)アルカノイル、(2-6C)アルカノイルオキシ、(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキル-(2-6C)アルカノイルアミノ、 \underline{N} -(1-6C)アルキルスルファモイル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジ-[(1-6C)アルキル]スルファモイル、(1-6C)アルカンスルホニルアミノ及び \underline{N} -(1-6C)アルキル-(1-6C)アルカンスルホニルアミノから選択される、同一または異なっているいてもよい、一つ以上（たとえば 1、2 または 3 個）の置換基を保持する、

及びフェニルまたはヘテロアリアル以外の Q^4 -Z-基内の任意の CH_2 または CH_3 基はそれぞれの CH_2 または CH_3 基の上に、一つ以上のハロゲンまたは (1-6C)アルキル置換基を保持する；

(uu) Q^4 はフェニル及び、5 または 6 員の単環式ヘテロアリアル環から選択され、このヘテロアリアル環は、酸素、窒素及び硫黄（特に酸素及び窒素から選択される、特に窒素）から選択される 1 個のヘテロ原子を含む、

及びここで Q^4 は場合により、(tt) で定義したような、同一または異なっているいてもよい、一つ以上（たとえば 1、2 または 3 個）の置換基を保持する；

(vv) Q^4 はフェニル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、1,3-チアゾリル、1H-イミダゾリル、1H-ピラゾリル、1,3-オキサゾリル及びイソキサゾリルから選択される、

及びここで Q^4 は場合により、(tt) で定義したような、同一または異なっているいてもよい、一つ以上（たとえば 1、2 または 3 個）の置換基を保持する；

(ww) Q^4 はフェニル及びピリジニル（たとえばピリジン-2-イルまたはピリジン-3-イル）から選択され、

及びここで Q^4 は場合により、(tt) で定義したような、同一または異なっているいてもよい、一つ以上（たとえば 1、2 または 3 個）の置換基を保持する；

(xx) Q^4 はフェニル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、1,3-チアゾリル、1H-イミダゾリル、1H-ピラゾリル、1,3-オキサゾリル及びイソキサゾリルから選択され、

及びここで Q^4 は場合により、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヒドロキシ、カルボキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、ビニル、アリル、エチニル、2-プロピニル、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、アセチル、プロピオニル、メチルアミノ、エチルアミノ、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジメチルアミノ、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジエチルアミノ、 \underline{N} -メチル- \underline{N} -エチルアミノ、 \underline{N} -メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、カルバモイル、 \underline{N} -メチルカルバモイル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジメチルカルバモイル、アセトキシ、アセトアミド、フルオロメチル、2-フルオロエチル、クロロメチル、2-クロロエチル、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、メトキシメチル、2-メトキシエチル、シアノメチル、2-シアノエチル、カルボキシメチル、2-カルボキシメチル、アミノメチル、メチルアミノメチル、エチルアミノメチル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジメチルアミノメチル、 $\underline{N},\underline{N}$ -ジエチルアミノメチル、 \underline{N} -メチル- \underline{N} -エチルアミノメチル、2-アミノエチル、2-(メチルアミノ)エチル、2-(エチルアミノ)エチル、2-($\underline{N},\underline{N}$ -ジメチルアミノ)エチル、2-($\underline{N},\underline{N}$ -ジエチルアミノ)エチル、2-(\underline{N} -メチル- \underline{N} -エチルアミノ)エチル、カルバモイルメチル、 \underline{N} -メチルカルバモイルメチル及び $\underline{N},\underline{N}$ -ジメチルカルバモイルメチルから選択される、同一または異なっているいてもよい、一つ以上（たとえば 1、2 または 3 個）の置換基を保持する；

(yy) Q^4 はフェニル及びピリジニル（たとえばピリジン-2-イルまたはピリジン-3-イル）から選択され、

及びここで Q^4 は場合により、(xx)で定義したような、同一または異なっているもよい、一つ以上（たとえば1、2または3個）の置換基を保持する；

(zz) Q^4 はフェニル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、1,3-チアゾリル、1H-イミダゾリル、1H-ピラゾリル、1,3-オキサゾリル及びイソキサゾリルから選択され、

及びここで Q^4 は場合により、フルオロ、クロロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシ及びエトキシ(特にフルオロ及びメチルから選択される)から選択される、同一または異なっているもよい、一つ以上（たとえば1、2または3個）の置換基を保持する；

(aaa) Q^4 はフェニル及びピリジニル(たとえばピリジン-2-イルまたはピリジン-3-イル)から選択される、

及びここで Q^4 は場合により、(zz)で定義したような、同一または異なっているもよい、一つ以上（たとえば1、2または3個）の置換基を保持する；

(bbb) Q^4 はフェニル、3-フルオロフェニル、ピリジン-2-イル及び6-メチルピリジン-3-イルから選択される；

(ccc) Q^4 は3-フルオロフェニル、ピリジン-2-イル及び6-メチルピリジン-3-イルから選択される；

(ddd) Q^4 は3-フルオロフェニルである；

(eee) Q^4 はピリジン-2-イルである；

(fff) Q^4 は6-メチルピリジン-3-イルである；

(ggg) Q^4 はフェニルである；

(hhh) Q^4 はフェニル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、1,3-チアゾリル、1H-イミダゾリル、1H-ピラゾリル、1,3-オキサゾリル及びイソキサゾリルから選択される、

及びここで Q^4 は場合により、フルオロ、クロロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシ及びエトキシ(特にフルオロ及びメチルから選択される)から選択される、同一または異なっているもよい、一つ以上（たとえば1、2または3個）の置換基を保持する、

及びZはO及びOC(R^{12})₂から選択され、ここで R^{12} はそれぞれ独立して、水素または(1-3C)アルキルである；

(iii) Q^4 はフェニル及びピリジニル(特にピリジン-2-イル)から選択される、

及びここで Q^4 は場合により(hhh)で定義したように、同一または異なっているもよい、一つ以上（たとえば1、2または3個）の置換基を保持する、

及びZはOC(R^{12})₂であり、ここで R^{12} はそれぞれ独立して水素または(1-3C)アルキルであり；及び

(jjj) Q^4 はピリジニル(特にピリジン-3-イル)であり、

及びここで Q^4 は場合により、(hhh)で定義したように、同一または異なっているもよい、一つ以上（たとえば1、2または3個）の置換基を保持し、

及びZはOである。